POWERED BY Dialog

New fungicidal substd. pyrazole derivs. - e.g. 2-pyridyl-(4-(4-chloro-phenyl-thio - -1,3-dimethyl-5-pyrazolyl)ketone are fungicides

Patent Assignee: NISSAN CHEM IND LTD

Patent Family

Patent Number	Kind	Date	Application Number	Kind	Date	Week	Type
JP 6065237	A	19940308	JP 9398060	A	19930423	199415	В

Priority Applications (Number Kind Date): JP 92115000 A (19920507)

Patent Details

Patent	Kind	Language	Page	Main IPC	Filing Notes
JP 6065237	A		23	C07D-403/12	

Abstract:

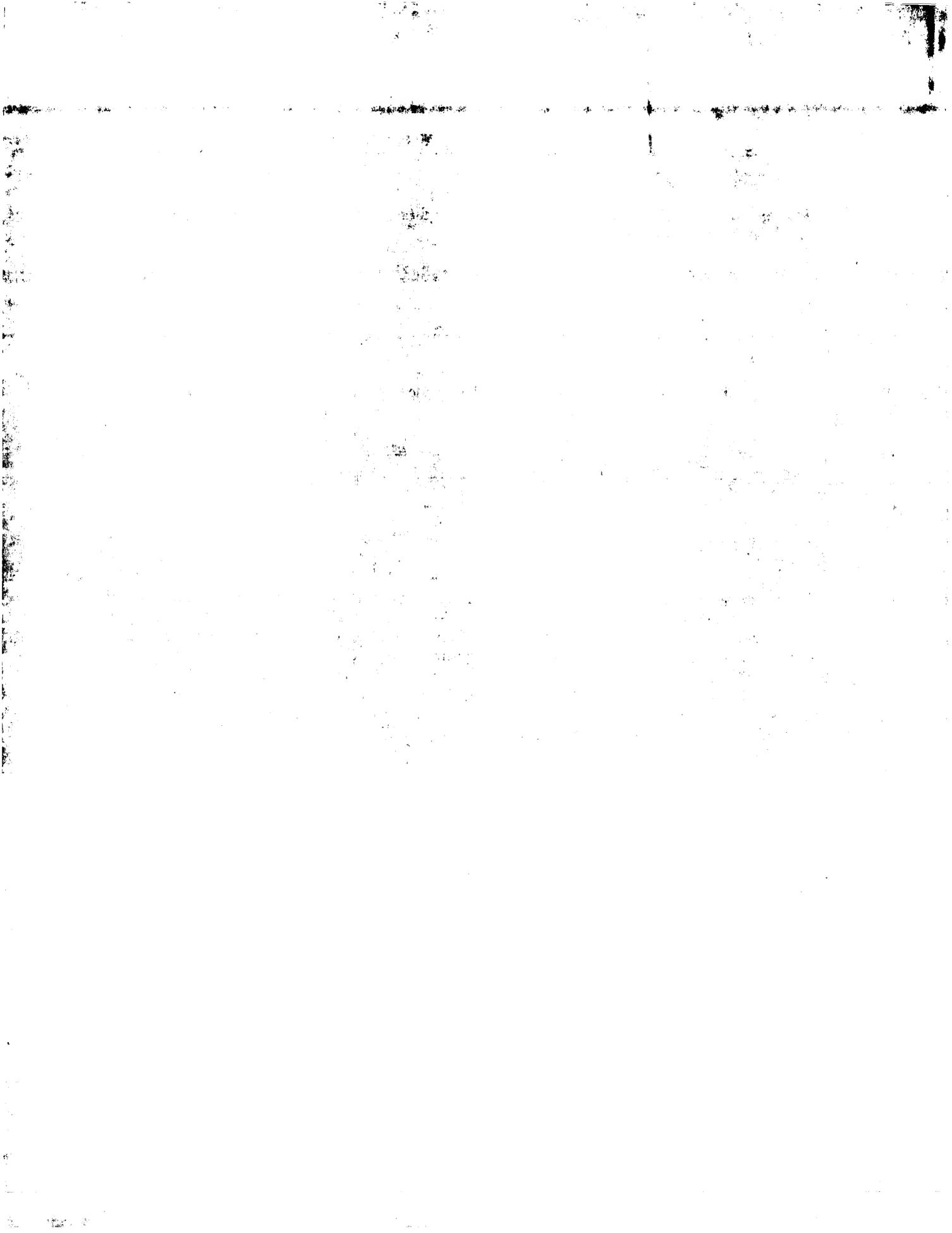
JP 6065237 A

Substd. pyrazole derivs. of formula (I) and their salts are new. In (I), R1 = halo, alkyl, alkoxy, alkylthio or haloalkyl; R2 = alkyl or haloalkyl; X = H, alkyl, haloalkyl, alkenyl, alkynyl, -COR6 or -SO2R7; R4, R5 = H, halo, alkyl, haloalkyl, alkenyl, alkynyl or -OR8; R8 = H, alkyl, haloalkyl, alkenyl, alkynyl, alkoxyalkyl, cyanoalkyl, alkylcarbonylalkyl, alkoxycarbonylalkyl, opt. substd. phenylalkyl, -COR6 or -SO2R7; R6 = H, alkyl, haloalkyl, opt. substd. phenyl opt. substd. phenylalkyl, alkoxy or -N(R9)(R10); R7 = alkyl, haloalkyl, opt. substd. phenyl or -N(R9)(R10); R9,. R10 = H, alkyl or opt. substd. phenyl; Y = O, -S-, -SO-, or -SO2-; A = opt. substd. phenyl; B = opt. substd. hetero ring; excluding (I), R1 = alkyl, X = -N(R3)-; and B = 2-pyridyl, 2-pyrimidyl or 2-pyrazyl).

USE - (I) Are fungicides.

Dwg.0/0

Derwent World Patents Index © 2001 Derwent Information Ltd. All rights reserved. Dialog® File Number 351 Accession Number 9841354



(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11)特許出願公開番号

特開平6-65237

(43)公開日 平成6年(1994)3月8日

(51) Int.Cl. ⁵	識別記号	庁内整理番号	FΙ			技術表示箇所
C 0 7 D 403/12	2 3 1	8829-4C				
A 0 1 N 43/56	С	8930-4H				
43/58	Α	8930-4H	•			
43/60		8930-4H				
43/66		8930-4H				
			審査請求	未請求	請求項の数8(全23頁)	最終頁に続く
(21) 出願番号	特願平5-98060		(71)	出願人	000003986	
					日産化学工業株式会社	
(22)出顧日	平成5年(1993)4月	123日			東京都千代田区神田錦町37	「目7番地1
			(72)	発明者	中島 康之	
(31)優先権主張番号	特顧平4-115000				千葉県船橋市坪井町722番地	1 日産化学
(32)優先日	平4 (1992) 5月7日	I			工業株式会社中央研究所内	
(33)優先権主張国	日本(JP)		(72)	発明者	渡辺 淳一	
					千葉県船橋市坪井町722番地	1 日産化学
	·				工業株式会社中央研究所内	
			(72)	発明者	杉山 泰久	
					千葉県船橋市坪井町722番地	1 日産化学
					工業株式会社中央研究所内	
						最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 置換ピラゾール誘導体および農団芸用殺菌剤

(式中、R¹はハロゲン原子、(ハロ)アルキル基、アルコキシ基、アルキルチオ基を;R²は(ハロ)アルキル基を;Xは-N(R³)-,-CO-,-C(R⁴)(R⁵)-を;Yは-O-,-S(O)₁-(但し、n=0,1,2)を;Aは(置換)フェニル基を;Bは(置換)複素環基(たとえばピリミジン-2-イル基)を表わし、R³は水素原子、アルカノイル基、アルキルスルホニル基等を;R⁴,R⁵は水素原子、ハロゲン原子、(ハロ)アルキル基、アルコキシ基等を示す〕で表される置換ピラゾール誘導体および農園芸用殺菌剤。

【効果】優れた農園芸用殺菌作用を示し、有用作物に対する薬害も認められないため、農園芸用殺菌剤として有

用である。

examples

· scope ordap

· Harapeutic field? Furgicides (Agnicultural)

1

【特許請求の範囲】

【請求項1】 式〔1〕:

【化1】

〔上記式中、R1は、ハロゲン原子、アルキル基、アルコ キシ基、アルキルチオ基またはハロアルキル基を表し、 R'は、アルキル基またはハロアルキル基を表し、Xは、 -N(R³)- 、-CO-または-C(R⁴)(R⁵)- を表し、R³は、水素 原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルケニル基、ア ルキニル基、-COR6 または-SO2R7を表し、R4およびR 5は、それぞれ独立に水素原子、ハロゲン原子、アルキ ル基、ハロアルキル基、アルケニル基、アルキニル基ま たは-OR®を表し、R®は、水素原子、アルキル基、ハロア ルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルコキシア ルキル基、シアノアルキル基、アルキルカルポニルアル 20 キル基、アルコキシカルポニルアルキル基、無置換もし くは置換基を有するフェニルアルキル基、-COR⁵ または -SO₂ R' を表し、R' は、水素原子、アルキル基、ハロアル キル基、無置換もしくは置換基を有するフェニル基、無 置換もしくは置換基を有するフェニルアルキル基、アル コキシ基または-N(Rº)(R¹º) を表し、R'は、アルキル 基、ハロアルキル基、無置換もしくは置換基を有するフ ェニル基または-N(Rº)(R¹º) を表し、RºおよびR¹º は、 それぞれ独立に水素原子、アルキル基または無置換もし くは置換基を有するフェニル基を表し、Yは、酸素原 30 子、-S- 、-SO-、または -SO₂-を表し、Aは、無置換も しくは置換基を有するフェニル基を表し、Bは、無置換 もしくは置換基を有する複素環基を表す。但し、R1が、 アルキル基で、Xが、-N(R3)- で、Bが、無置換の2-ビリジル基、無置換の2-ビリミジル基または無置換の 2-ビラジル基の場合を除く。〕で表される置換ピラゾ ール誘導体またはその塩。

【請求項2】 Aが、ハロゲン原子、アルキル基および ハロアルキル基から選ばれた置換基の一種以上を有する 体。

【請求項3】 Xが、-N(R³)- である請求項2記載の置 換ピラソール誘導体

【請求項4】 Yが、-S- である請求項3記載の置換ビ ラゾール誘導体。

【請求項5】 R'が、低級アルキル基またはハロゲン原 子であり、R²が、低級アルキル基である請求項4記載の 置換ピラゾール誘導体。

【請求項6】 Bが、無置換もしくは置換基を有するピ リジル基または無置換もしくは置換基を有するピリミジ 50 ルポニルアルキル基、アルコキシカルポニルアルキル

2

ル基である請求項5記載の置換ピラゾール誘導体。

【請求項7】 R1が、ハロゲン原子である請求項6記載 の置換ピラゾール誘導体。

請求項1記載の置換ピラゾール誘導体の 【請求項8】 1種または2種以上を有効成分として含有する農園芸用 殺菌剤。

【発明の詳細な説明】

[0001]

【産業上の利用分野】本発明は、新規なピラゾール誘導 10 体および該誘導体を有効成分として含有する農園芸用殺 菌剤に関する。

[0002]

[従来の技術] これまで種々の殺菌剤が開発されてきて いるが、その効力や耐性菌の出現等で必ずしも満足すべ きものとは言えない。また特開平 1-125379 号公報、EP -459333A1 、特開平3-141276号公報には、ある種のピラ ソール誘導体が殺菌活性を有することが記載されてい る。

[0003]

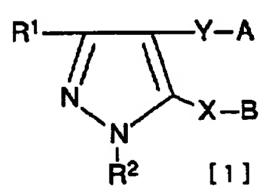
【発明が解決しようとする課題】上記の公開公報に記載 されている化合物においても、効力、残効性、薬害等の 点で満足すべきものではなく、植物病害に対して更に有 用な農園芸用殺菌剤の開発が要望されている。

[0004]

【課題を解決するための手段】本発明者らは、このよう な状況に鑑み、優れた殺菌活性を有する化合物を開発す べく種々検討を重ねた結果、下記式〔1〕で示される置 換ピラゾール誘導体が、優れた殺菌活性を有することを 見出し本発明に至った。すなわち、本発明は、式 (1):

[0005]

【化2】



【0006】〔上記式中、R1は、ハロゲン原子、アルキ フェニル基である請求項1記載の置換ピラゾール誘導 40 ル基、アルコキシ基、アルキルチオ基またはハロアルキ ル基を表し、R²は、アルキル基またはハロアルキル基を 表し、Xは、-N(R³)- 、-CO-または-C(R¹)(R⁵)- を表 し、R^aは、水素原子、アルキル基、ハロアルキル基、ア ルケニル基、アルキニル基、-COR6 または-SO2R7を表 し、R⁴ およびR⁵ は、それぞれ独立に水素原子、ハロゲン 原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルケニル基、ア ルキニル基または-OR®を表し、R®は、水素原子、アルキ ル基、ハロアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、 アルコキシアルキル基、シアノアルキル基、アルキルカ

基、無置換もしくは置換基を有するフェニルアルキル 基、-COR® または-SOz RTを表し、R®は、水素原子、アル キル基、ハロアルキル基、無置換もしくは置換基を有す るフェニル基、無置換もしくは置換基を有するフェニル アルキル基、アルコキシ基または-N(Rº)(R¹º) を表し、 R'は、アルキル基、ハロアルキル基、無置換もしくは置 換基を有するフェニル基または-N(Rº)(R¹º) を表し、Rº およびRio は、それぞれ独立に水素原子、アルキル基ま たは無置換もしくは置換基を有するフェニル基を表し、 は、無置換もしくは置換基を有するフェニル基を表し、 Bは、無置換もしくは置換基を有する複素環基を表す。 但し、R¹が、アルキル基で、Xが、-N(R³)- で、Bが、 無置換の2-ピリジル基、無置換の2-ピリミジル基ま たは無置換の2-ビラジル基の場合を除く。〕で表され る置換ピラゾール誘導体またはその塩および該誘導体を 有効成分として含有する農園芸用殺菌剤に関するもので ある。

【0007】本発明において、上記式中の置換基は下記 の意味を有する。ハロゲン原子はフッ素、塩素、臭素お 20 よびヨウ素を意味し、好ましくはフッ素、塩素、臭素を 示す。アルキル基、アルコキシ基およびアルキルチオ基 のアルキルの炭素数は、それぞれ1~6を意味し、例え ばメチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、n-, s-,i-もしくはt-プチル、ペンチル、ヘキシル、 メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロポキシ、n ー, s ー, i ーもしくは t ープトキシ、ペントキシ、ヘ キソキシ、メチルチオ、エチルチオ、n-もしくはi-プロピルチオ、n-,s-,i-もしくはt-ブチルチ オが挙げられる。好ましくは、メチル、エチル、n-も 30 しくはi-プロピル、n-、s-、i-もしくはt-ブ チル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロポキ シ、n-, s-, i-もしくはt-プトキシが挙げられ る。

【0008】ハロアルキル基のアルキルの炭素数は1~6を意味し、例えばフルオロメチル、ジフルオロメチル、プロモメチル、トリフルオロエチル、トリクロロエチル、トリフルオロプロピルなどが挙げられる。置換基を有するフェニル基は、その置換基の数は1~5であり、その置換基の40種類は、同じかまたは相異なってもよい。その置換基としてハロゲン原子、アルキル基、ハロアルキル基、アル

コキシ基、アルキルチオ基、ニトロ基、シアノ基等で置換されたフェニル基が挙げられる。但し、上記の定義中のnはノルマルを、iはイソを、sはセカンダリーを、tはターシャリーを表す。

アルキル基、アルコキシ基または-N(R*)(R**)(R**)を表し、 【0009】上記のBで表される複素環とは、窒素原子 R**は、アルキル基、ハロアルキル基、無置換もしくは置 を1つ以上含有する5もしくは6員環複素環または窒素 原子を1つ以上含有する縮合複素環を表し、例えばピリ およびR**。は、それぞれ独立に水素原子、アルキル基ま たは無置換もしくは置換基を有するフェニル基を表し、 ソロール、ピラゾール、イミダゾール、チアゾー Yは、酸素原子、-S-、-SO-、または -SO2-を表し、A 10 ル、オキサゾールなどが挙げられる。その置換基として は、無置換もしくは置換基を有するフェニル基を表し、 ル・カーデン原子、アルキル基、アルコキシ基、ハロア ルキル基、ハロアルコキシ基などが挙げられる。

【0010】R¹の置換基としては、好ましくは低級アルキル基またはハロゲン原子であり、より好ましくはハロゲン原子を表す。R³の置換基としては、好ましくはアルキル基を表す。Yは好ましくは-S-を表し、Xは好ましくは-N(R³)-を表し、R³は好ましくは水素原子または-CHOを表す。Aは好ましくはハロゲン原子、アルキル基およびハロアルキル基から選ばれた置換基の一種以上を有するフェニル基を表し、Bは好ましくは無置換もしくは置換基としてハロゲン原子を有するピリジル基または無置換もしくは置換基としてハロゲン原子を有するピリミジル基を表す。

【0011】次に、式〔1〕で表される本発明化合物を第1表に示す。但し、本発明化合物はこれらのみに限定されるものではない。化合物No. は、後の記載において参照される。なお各表中のPh はフェニル基を、i はイソを、t はターシャリーを、Etはエチル基を、Prはプロビル基を示す。

70 【0012】第 1 表

[0013]

[化3]

【0014】で表される化合物において 【0015】 【表1】

化合物No.	R¹	R²	Х	Ÿ	W _a	В	
1	Cl	СНз	NH	S	4-C1.	B 1	
2	Cl	CH ₃	NH	S	2, 4-Cl ₂	B 1	
3	Cl	СНз	NH	S	3-C1,4-CH₂	B 1	
4	Cl	CH ₃	NCHO	S	4-C1	B 1	
5	CI	CH ₃	. NH	S	4-CH ₃	B 1	

6

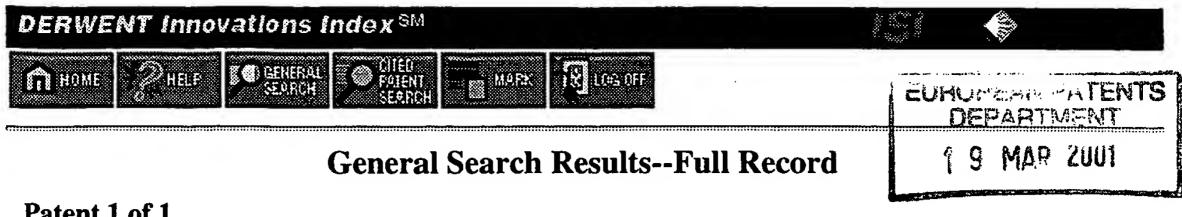
5	•					
6	Cl	CH ₃	NH	S	2, 4-Cl2	B 1
7	Cl	CH ₃	NH	S	2, 3-Cl ₂	B 1
8	CH ₃ 0	CH ₃	NH	S	4-C1	B 1
9	CH ₃ 0	CH ₃	NH	S	3-C1, 4-CH ₃	B 1
10	CH ₃ 0	CH ₃	NH	S	2, 4-Cl ₂	B 1
1 1	CH ₃ 0	CH ₃	NH	S	2-F, 4-CH ₃	B 1
1 2	CH ₃ 0	СНз	NH	S	3-F, 4-CH ₃	B 1
1 3	CH ₃ 0	CH ₃	NCH0	S	2, 4-Cl ₂	B 1
14	CH ₃ 0	CH3	NCH0	S	3-C1, 4-CH ₈	B 1
15	CH ₃ S	CH ₃	NH	S	4-C1	B 1
16	CH ₃ S	CH ₃	NH	S	3, 4-Cl ₂	B 1
17	CH ₃ S	CH ₃	NH	S	2, 4-Cl ₂	B 1
18	CH ₃ S	CH ₃	NH	S	3-C1,4-CH₃	B 1
19	CH ₂ S	CH₃	NH	S	2-C1, 4-CH3	B 1
20	CH ₂ S	CH ₃	NH	S	3-F, 4-CH ₃	B 1
2 1	Cl	CH ₂	NH	S	4-C1	B 2
2 2	Cl	СНз	NH	S	2, 4-Cl ₂	B 2
23	Cl	СНа	NCH ₃	S	4-C1	B 1

[0016]

20【表2】

第 1 表 (続き)

化合物No.	\mathbb{R}^1	R²	Х	Y	W	В
2 4	CI	CH ₃	NCH ₃	s	2,4-Cl2	В1
2 5	Cl	CH ₃	NCH ₃	S	3-C1, 4-CH ₃	B 1
2 6	CI	CH₂	NE t	S	4-C1	B 1
2 7	Cl	CH ₃	N-i-Pr	S	4-CH ₃	B 1
2 8	CI	Et	NH	S	2,4-Cl2	B 1
2 9	Cl	i-Pr	NH	S	2,4-Cl ₂	B 1
3 0	Cl	CHF ₂	NH	S	4-C1	B 1
3 1	Cl	CHF ₂	NH	S	3-C1, 4-CH ₃	B 1
3 2	CI	CP ₃	NH	S	2, 4-Cl2	B 1
3 3	Cl	CF ₃	NH	S	2-F, 4-CH ₃	B 1
3 4	CI	CH₂	NSO ₂ CH ₃	S	3-F, 4-CH ₃	B 1
3 5	Cl	CH ₃	NSO ₂ CH₃	S	2, 4-Cl2	B 1
3 6	C1	СН₃	NSO₂ CH₃	S	3-C1, 4-CH₃	B 1
3 7	CI	СНя	NCH ₂	S	3-C1. 4-CHa	B 2



Patent 1 of 1

Patents Cited by Inventor: 0 Patents Cited by Examiner: 0

Citing Patents: 0

Articles Cited by Inventor: 0 Articles Cited by Examiner: 0

Patent Number(s): JP06065237-A

Title:

New fungicidal substd. pyrazole derivs. - e.g. 2-pyridyl-(4-(4-chloro-phenyl-thio_-1,3-di:methyl-5pyrazolyl)ketone are fungicides

Patent Assignee Name(s) and Code(s): NISSAN CHEM IND LTD (NISC)

Derwent Primary Accession Number: 1994-121210 [15]

Abstract:

Substd. pyrazole derivs. of formula (I) and their salts are new. In (I), R1 = halo, alkyl, alkoxy, alkylthio or haloalkyl; R2 = alkyl or haloalkyl; X = H, alkyl, haloalkyl, alkenyl, alkynyl, -COR6 or -SO2R7; R4, R5 = H, halo, alkyl, haloalkyl, alkenyl, alkynyl or -OR8; R8 = H, alkyl, haloalkyl, alkenyl, alkynyl, alkoxyalkyl, cyanoalkyl, alkylcarbonylalkyl, alkoxycarbonylalkyl, opt. substd. phenylalkyl, -COR6 or -SO2R7; R6 = H, alkyl, haloalkyl, opt. substd. phenyl opt. substd. phenylalkyl, alkoxy or -N(R9)(R10); R7 = alkyl, haloalkyl, opt. substd. phenyl or -N(R9)(R10); R9,. R10 = H, alkyl or opt. substd. phenyl; Y = O, -S-, -SO-, or -SO2-; A = opt. substd. phenyl; B = opt. substd. hetero ring; excluding (I), R1 = alkyl, X = -N(R3)-; and B = 2-pyridyl, 2-pyrimidyl or 2-pyrazyl).

USE - (I) Are fungicides.

International Patent Classification:

A01N-043/56; A01N-043/58; A01N-043/60; A01N-043/66; A01N-043/707; A01N-043/78; C07D-401/06; C07D-401/12; C07D-403/06; C07D-403/12; C07D-417/06; C07D-417/12

Derwent Class:

C02 (Heterocyclic)

Derwent Manual Code(s):

C07-D08; C14-A04

Patent Publication Date, Page Count and Language:

JP06065237-A 8 Mar 1994 Pages: 23

Application Details and Date:

JP06065237-A JP-0098060 23 Apr 1993

Priority Appl JP-0115000	ication Information and Date: 7 May 1992	·		
Patent 1 of	1		,	

Acceptable Use Policy

Copyright © 2001 <u>Institute for Scientific Information</u> and <u>Derwent Information Ltd.</u>

SUBSTITUTED PYRAZOLE DERIVATIVE AND GERMICIDE FOR AGRICULTURE AND HORTICULTURE

Patent Number: JP6065237
Publication date: 1994-03-08

Inventor(s): NAKAJIMA YASUYUKI; others: 01

Applicant(s):: NISSAN CHEM IND LTD

Requested Patent: <u>IJP6065237</u>

Application Number: JP19930098060 19930423

Priority Number(s):

IPC Classification: C07D403/12; A01N43/56; A01N43/58; A01N43/60; A01N43/66; A01N43/707;

A01N43/78; C07D401/06; C07D401/12; C07D403/06; C07D417/06; C07D417/12

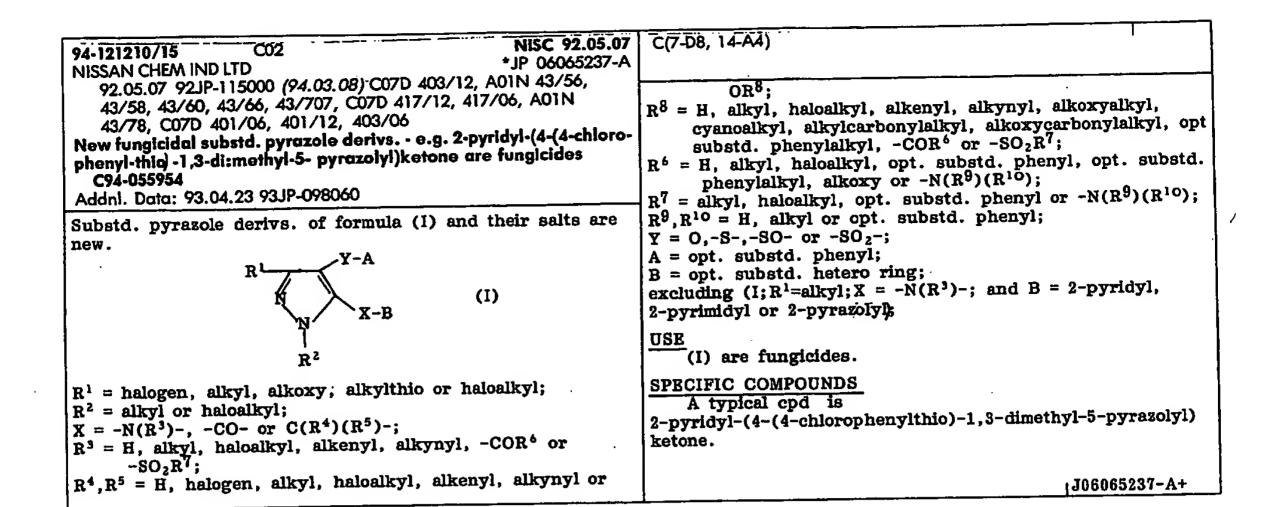
EC Classification:

Equivalents:

Abstract

PURPOSE:To provide a novel compound useful as a germicide for agriculture and horticulture. CONSTITUTION:A compound of formula I [R<1> is halogen, (halo)alkyl, alkoxy, alkylthio; R<2> is (halo)alkyl; X is -N(R<3>)-, -CO-, -C(R<4>)(R<5>)-; Y is -O-, -S(O)-; (n) is 0-2; R<3> is H, alkanoyl, etc.; R<4>, R<5> are H, halogen, alkoxy, etc.; A is (substituted)phenyl; B is (substituted)heterocyclic group], e.g. 2-pyridyl-(4-(4- chlorophenylthio)-1,3-dimethyl-5-pyrazolyl)methanol. The compound of formula I is obtained by reacting a substituted pyrazole of formula II (X is -N(R<3>)-) with a heterocyclic compound of formula: L-B (L is a releasing group such as halogen), if necessary, in the presence of a base in a solvent. The compound of formula I is useful for plant diseases such as gray mold, rice sheath blight, melon downy mildew, and the melanose, powdery mildew, bitter rot and epidemic of citruses.

Data supplied from the esp@cenet database - I2



() 1994 Derwent Information Ltd

